

**SOLUBILIZING AGENT AND COSMETIC CONTAINING THE SAME**

Patent Number: JP9315932  
Publication date: 1997-12-09  
Inventor(s): KAMINUMA MIKIKO; NAKAJIMA HIDEO  
Applicant(s):: SHISEIDO CO LTD  
Requested Patent: ☐ JP9315932  
Application Number: JP19960165334 19960604  
Priority Number(s):  
IPC Classification: A61K7/00 ; A61K47/26 ; C07H13/06 ; C11D1/66  
EC Classification:  
Equivalents:

**Abstract**

**PROBLEM TO BE SOLVED:** To obtain a solubilizing agent useful in the medicinal and cosmetic fields, containing a branched aliphatic polyglycoside having a specific average polymerization degree.  
**SOLUTION:** This solubilizing agent contains a branched aliphatic polyglycoside of the formula Gn-O-R (Gn is a residue formed by eliminating glycosidic hydroxyl groups from a product formed by dehydrocondensation of monosaccharide G and having a polymerization degree of (n); (n) is an integer of  $\geq 1$ ; R is an 8-32C branched aliphatic chain as a result of forming glycoside linkage to Gn) with an average polymerization degree of  $\geq 2.1$ . If being  $< 2.1$  in the average polymerization degree, this solubilizing agent is inadequate in function as such, while if  $\geq 2.1$ , this agent presents excellent safety, stability and solubilizing ability, having favorable use feeling when applied to the skin. A skin cosmetic or hair cosmetic can be prepared by formulating 0.5-60wt.% of this solubilizing agent in the corresponding cosmetic base.

Data supplied from the esp@cenet database - 12 -

11017 U.S. PTO  
10/000001



11/13/01

BEST AVAILABLE COPY

(19)日本国特許庁 (J P)

(12) 公 開 特 許 公 報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開平9-315932

(43)公開日 平成9年(1997)12月9日

(51)Int.Cl. <sup>9</sup>	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
A 6 1 K 7/00			A 6 1 K 7/00	F
47/26			47/26	G
C 0 7 H 13/06			C 0 7 H 13/06	
C 1 1 D 1/66			C 1 1 D 1/66	

審査請求 未請求 請求項の数2 F D (全 5 頁)

(21)出願番号	特願平8-165334	(71)出願人	000001959 株式会社資生堂 東京都中央区銀座7丁目5番5号
(22)出願日	平成8年(1996)6月4日	(72)発明者	上 昭 三紀子 神奈川県横浜市港北区新羽町1050番地 株 式会社資生堂第一リサーチセンター内
(31)優先権主張番号	特願平8-99204	(72)発明者	中 島 英夫 神奈川県横浜市港北区新羽町1050番地 株 式会社資生堂第一リサーチセンター内
(32)優先日	平 8 (1996) 3 月 27 日	(74)代理人	弁理士 岩橋 祐司
(33)優先権主張国	日本 (J P)		

(54)【発明の名称】 可溶化剤及びそれを含有する化粧品

(57)【要約】

【課題】 優れた安全性、安定性、使用性及び可溶化能を発揮し、良好な使用感を有する新規な可溶化剤及びそれを含有する化粧料を提供する。

【解決手段】 本発明の可溶化剤は、化1で表される分岐脂肪族ポリグリコシドを含有し、且つ、分岐脂肪族ポリグリコシドの平均重合度が2.1以上であることを特徴とする。

【化1】Gn-O-R

BEST AVAILABLE COPY

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記一般式化1で表される分岐脂肪族ポリグリコシドを含有し、且つ、前記分岐脂肪族ポリグリコシドの平均重合度が2.1以上であることを特徴とする可溶化剤。

【化1】  $Gn-O-R$ 

(式中、Gnは単糖Gが重合度nで脱水縮合したものからグリコシド性水酸基を除いた残基を意味する。なお、nは1以上の整数である。また、RはGnとグリコシド結合している、且つ全炭素数が8～32である分岐脂肪鎖を意味する。)

【請求項2】 請求項1記載の可溶化剤を含有する化粧料。

## 【発明の詳細な説明】

## 【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、可溶化剤、特に分岐脂肪族ポリグリコシドを含有する可溶化剤に関する。

## 【0002】

【従来の技術】医薬品や化粧品等の分野において可溶化剤は広く用いられている。代表的な可溶化剤は非イオン性界面活性剤であり、例えば、グリセリン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステル、ショ糖脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレングリコール脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油誘導体、マンニトールヒドロキシ脂肪酸エステル等が挙げられる。

## 【0003】

【発明が解決しようとする課題】このような可溶化剤を医薬品や化粧品に利用する場合、良好な可溶化能を有することはもちろん、これらは人体に使用するために高い安全性を要求され、また、安定性においても優れたものであることが望ましい。しかしながら、最近になって非イオン性界面活性剤の安全性や安定性に問題点が指摘されている。

【0004】例えば、エステル部を有する化合物については加水分解が起きやすく、安定性に問題があり、また、ポリオキシエチレン鎖を親水基に持つものは経時で酸化劣化を受けやすく、低分子量のアルデヒドや有機酸を発生し、変臭や刺激性の原因となるなど、やはり安定性や安全性に問題がある。そして、グリセリンの誘導体は安定性、安全性は良好であるものの、合成上グリセリンの重合度がなかなか上らず、親水性に乏しいという問題点があった。

【0005】また、可溶化量は可溶化剤の量に依存することは当然であるが、界面活性剤の場合にはそのHLBにより可溶化量は著しく変化し、さらに、例えば油分を可溶化するような場合にはその油分の構造によっても大きく変化する。すなわち、最適な可溶化状態を得るため

には、可溶化される油分と、可溶化剤のHLBやその構造がマッチすることが必要であり、従って、新規の可溶化剤の開発は可溶化の可能性を広げることにつながる。

【0006】また、マルチール脂肪酸ヒドロキシエーテルのように安全性、安定性に優れたものもあるが、皮膚外用剤において、使用時に泡が立ちやすいものは好ましくなかった。以上のことから、安全性、安定性、使用性及び可溶化能のいずれも満足することができるような新規の可溶化剤の開発が望まれていた。本発明はこのような従来技術の課題に鑑み成されたものであり、その目的は、安全性、安定性、使用性及び可溶化能のいずれも満足することができるような新規の可溶化剤及びこれを配合した化粧料を提供することにある。

## 【0007】

【課題を解決するための手段】本発明者らは前記目的を達成するため鋭意検討を行った結果、これまで安全性、安定性の高い増粘ゲル化剤として知られていた分岐脂肪族ポリグリコシドが、特定の平均重合度を有する場合には可溶化剤として機能することを見出し本発明を完成した。すなわち、本発明は一般式化2で表される分岐脂肪族ポリグリコシドを含有し、且つ、前記分岐脂肪族ポリグリコシドの平均重合度が2.1以上であることを特徴とする可溶化剤及びこれを配合した化粧料に関するものである。

## 【0008】

【化2】  $Gn-O-R$ 

(式中、Gnは単糖Gが重合度nで脱水縮合したものからグリコシド性水酸基を除いた残基を意味する。なお、nは1以上の整数である。また、RはGnとグリコシド結合し、且つ全炭素数が8～32である分岐脂肪鎖を意味する。)

## 【0009】

【本発明の実施の形態】以下、本発明の実施の形態について詳述する。前記一般式化2において、Gnは単糖Gが重合度nで脱水縮合したものからグリコシド性水酸基を除いた残基を表す。単糖Gの具体例としては、グルコース、ガラクトース、キシロース、フルクトース、アルトロース、タロース、マンノース、アラビノース、イドース、リキソース、リボース、アロース等の単糖類及びその混合物が挙げられる。なお、重合度nは1以上の整数であり、nが1の場合には単糖は脱水縮合しておらず、一つの単糖がRとグリコシド結合しているのみである。

【0010】次に、Rは前記Gnとグリコシド結合によって結合している分岐脂肪鎖で、総炭素数8～32である。分岐鎖の具体例としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、ペンチル基、ヘキシル基、ヘプチル基、オクチル基、ノニル基、デシル基、ウンデシル基、ドデシル基、トリデシル基、テトラデシル基、ヘプタデシル基、ヘキサデシル基、ヘ

ブタデシル基、更にはそれ以上の高級脂肪酸鎖が挙げられる。このような分岐鎖の位置ならびに数は特に限定されない。Rの具体例としては、2-デシルテトラデシル基、2-テトラデシルオクタデシル基、イソステアシル基、2,7-ジメチルヘキサデシル基、テトラヒドラゲラニル基、2,7-ジメチルオクタデシル基等が挙げられる。Rは疎水基であり、そのバランスと工業性より炭素数の合計が8~32であることが好ましい。

【0011】本発明に係る分岐脂肪酸ポリグリコシドは、分岐脂肪酸アルコールと糖の脱水縮合反応で得ることができる他、特開昭63-84637の糖類変性用酸触媒を用いる方法や、一般にグリコシル化に用いられる反応(ケーニッヒークノール反応、ヘルフエライヒ法や、それ以外のエーテル交換法等)で合成することができる。

【0012】これらの合成反応の工程中に原料として用いられる糖同士が重合し、このため得られる分岐脂肪酸ポリグリコシドは大抵糖の重合度や糖同士の結合位置が異なる混合物として得られる。本発明においてはこのような混合物であっても、分岐脂肪酸ポリグリコシドの平均重合度が2.1以上である場合にはそのまま用いることができる。もちろん、本発明の特徴である分岐脂肪酸ポリグリコシドの平均重合度を有するのであれば、混合物を適宜精製してより純度の高い分岐脂肪酸ポリグリコシドとして用いても良いし、これらを調合し直して用いてもよい。

【0013】本発明の可溶化剤を構成する分岐脂肪酸ポリグリコシドは物質としては公知であり、これまでに安定性、安全性に優れ、ゲル化能を有することや、乳化安定剤としての機能を有することが知られていた(特開平4-76082号公報、特開平4-89494号公報)。しかしながら、このような分岐脂肪酸ポリグリコシドがその平均重合度によっては可溶化剤としての機能を発揮することはこれまで知られておらず、本発明によって今回初めて明らかにされたものである。

【0014】本発明の可溶化剤は前記化2の分岐脂肪酸ポリグリコシドを含有し、且つその平均重合度が2.1以上であることが必要である。平均重合度が2.1未満の場合には可溶化剤としての機能が十分に発揮されない。本発明の可溶化剤は常温で油状又は固体であり、水に溶解すると透明溶液となり、既存の非イオン型界面活性剤に比べ泡立ちが低い。平均重合度が2.1未満の分岐脂肪酸ポリグリコシドの場合には水に溶解すると増粘ゲル化能が発揮されて系が増粘し、分岐脂肪酸ポリグリコシドの濃度に依存して粘度が上昇するのとは対照的である。また、本発明の可溶化剤は、皮膚や毛髪に適用した場合には使用感が良好で、しっとりとした使用感が得られる。

【0015】以上のような性質から、本発明の可溶化剤は皮膚化粧料の他、シャンプー、リンス、トリートメン

ト、整髪料、染毛料、カラーリンス等各種頭髪化粧料に配合することができる。また、医薬品への応用も可能であり、その他可溶化剤を必要とする様々な産業分野においての利用が期待される。

【0016】本発明の化粧料において配合される、本発明に係る可溶化剤の配合量は本発明の効果が得られる範囲であれば別段限定されず、可溶化したい成分やその量などによって配合量を適宜調整して用いることができるが、一般的には0.5~60重量%である。また、本発明の化粧料においては可溶化剤として上記分岐脂肪酸ポリグリコシドの他に、本発明の効果を損なわない限り通常化粧料に用いられる他の成分も適宜配合することができる。

【0017】例えば、流動パラフィン、スクワラン、ワセリン、セチルアルコール、イソステアシルアルコール、2-エチルヘキシルアルコール、2-エチルヘキサン酸セチル-2-オクチルドデシルアルコール、トリイソステアリン酸グリセリン、マカデミアンナッツ油、ラノリン等の各種炭化水素、油脂類、ロウ類等の油性成分、シリコーン類、他の界面活性剤、増粘剤、中和剤、防腐剤、殺菌剤、酸化防止剤、粉体成分、色素、香料、紫外線吸収剤、薬効剤、金属封鎖剤、pH調整剤等が挙げられるが、これらに限定されるものではない。

【0018】また、通常染毛剤に用いられる公知の成分、例えば、酸化染料、酸性染料、各種アルコール類、有機溶剤、pH調整剤、無機酸、保湿剤、油性成分、金属イオン封鎖剤、防腐剤、カチオン性高分子類、pH調整剤、香料、薬剤、水、他の両親媒性物質や界面活性剤、増粘剤、蛋白質加水分解物及びこれらの四塩化塩、酸化防止剤、安定化剤、アルカリ剤、酸化剤等も配合することができる。以下に本発明の実施の形態について、前記化2においてRがイソステアシル基、Gがグルコースであるイソステアシルポリグリコシドの場合を例としてさらに詳述する。

【0019】まず、イソステアシルポリグリコシドの製造方法について説明する。

#### 製造例1 イソステアシルポリグリコシド

イソステアシルアルコール10.05g(378mmol)にグルコース40.5g(225mmol)及びパラトルエンスルホン酸0.19g(1mmol)を加え、攪拌しながら、窒素導入下、減圧で16時間反応した。反応物を室温まで冷却し、反応系に精製水、酢酸エチル、メタノールを加え分配した。水層を濃縮し、得られたシロップをアセトンで洗浄してイソステアシルポリグリコシドを得た。得られたイソステアシルポリグリコシドのグルコースの平均重合度は、イソステアシルポリグリコシド25mgにトリメチルクロロシラン0.5ml、N,O-(ビストリメチルシリル)アセタミド0.5ml、N-トリメチルシリルイミダゾール0.5mlを加え、80℃の湯浴上30分間TMS化し、キャピラリーガスクロマトグラフ

法(カードレックス アルミニウムスーパーキャップドカラム(メチルシリコン  $1\mu\text{m}\times 10\text{m}$ ) スプリット比1/20、昇温速度 $100\sim 420^\circ\text{C}$ 、 $10^\circ\text{C}/\text{min}$ 、キャリアガス:ヘリウム、 $50\text{ml}/\text{min}$ 、検出器:FID)によってピークの面積強度より求めたところ、グルコースの平均重合度は2.4であった。

#### 【0020】製造例2 イソステアрилモノグルコシドの製造

イソステアリアルアルコール $10.05\text{g}$ ( $378\text{mmol}$ )、ペンタアセチルグルコース $2\text{g}$ 、リンモリブデン酸 $10\text{mg}$ にトルエン $20\text{ml}$ を加え $90^\circ\text{C}$ まで昇温した後、 $20\text{mmHg}$ の減圧下にて加熱撹拌を30分間行った。空冷後、トルエンで抽出し、ろ過後、飽和食塩水、精製水で1回づつ洗浄し、乾燥後減圧濃縮した。得られたシロップをシリカゲルクロマトグラム法(ワコゲルC-200、ヘキサン/酢酸エチル)にて精製して、イソステアрилモノグルコシドのアセチル化物を得た。得られたアセチル化物をメタノールに溶解し、ナトリウムメチラートを加え、室温にて30分間撹拌し、脱アセチル化した。反応後、樹脂(アンバーライト120

B)にて中和し、樹脂をろ去した後、得られた母液を濃縮して目的のイソステアрилモノグルコシドを得た。

#### 【0021】試験例1 可溶化能

種々の平均重合度を有するイソステアрилポリグルコシドを調製し、その可溶化能を調べた。方法は、イソステアрилポリグルコシド2%水溶液を調製し、この水溶液に撹拌しながらリモネン $0.5\text{g}$ を滴下し、7日間撹拌した溶液について、性状及び外観の観察ならびに粘度の測定を行った。なお、イソステアрилポリグルコシドの平均重合度の調整は、製造例1で調製した平均重合度2.4のイソステアрилポリグルコシドに製造例2で得られたイソステアрилモノグルコシドを加えることによつて行った。また、粘度の測定は、E型粘度計(トキメック社製、VISCONIC ED形)を用いて、温度 $25^\circ\text{C}$ 、コーンローター  $0.5\text{rpm}$ の条件下で測定した。

【0022】性状及び油相の分離の有無を表1に、また、粘度の測定結果を図1に示す。

【表1】

イソステアрилポリグルコシドの 平均重合度	性状	油相分離
1.9	白濁ゲル状	あり
2.0	白濁ゲル状	あり
2.1	透明な僅かに粘稠な溶液	なし
2.15	透明液状	なし
2.2	透明液状	なし
2.3	透明液状	なし

【0023】表1から判るように、平均重合度が2.1未満の場合にはイソステアрилポリグルコシドの増粘ゲル化能が発揮され、系はゲル状となり、また、油相が分離して油分を可溶化することができなかった。これに対して、イソステアрилポリグルコシドの平均重合度が2.1以上の場合には可溶化能が発揮され、油分は可溶化されて均一で透明な1液相を呈し、また、溶液は低粘度の液状で粘度の増加は認められなかった。

【0024】図1はイソステアрилポリグルコシドの平均重合度による粘度変化を示した図であるが、平均重合度2.1未満で増粘ゲル化能が発揮されて系の粘度が高くなっているが、平均重合度2.1以上の場合には増粘ゲル化能が全く発揮されていないことがわかる。以上のことから、本発明の可溶化剤において、分岐脂肪族ポリグリコシドの平均重合度は2.1以上であることが必要であることが理解される。

#### 【0025】

##### 配合例1 化粧水

(1)エタノール

【実施例】以下、本発明に係る可溶化剤である分岐脂肪族ポリグリコシドの製造例及びそれを配合した化粧料の配合例を挙げるが、本発明はこれに限定されるものではない。

#### 製造例3 イソミリスチルポリグルコシド

イソミリスチリアルアルコール $7.97\text{g}$ ( $378\text{mmol}$ )にグルコース $40.5\text{g}$ ( $225\text{mmol}$ )及びバタトルエンスルホン酸 $0.19\text{g}$ ( $1\text{mmol}$ )を加え、撹拌しながら、窒素導入下、減圧で16時間反応した。反応物を室温まで冷却し、反応系に精製水、酢酸エチル、メタノールを加え分配した。水層を濃縮し、得られたシロップをアセトン洗浄してイソミリスチルポリグルコシドを得た。得られたイソミリスチルポリグルコシドのグルコースの平均重合度を製造例1と同様にして調べたところ、平均重合度は2.6であった。

#### 【0026】

20.0wt%

(2)ヒアルロン酸	5.0
(3)カルボキシビニルポリマー	0.3
(4)エチルパラベン	0.1
(5)イソステアрилポリグルコシド (平均重合度2.5)	5.0
(6)精製水	残 余
(7)香料	適 宜

【0027】(1)～(6)をよく混合して溶解し、化粧水を得た。この化粧水は透明な外観を呈し、しっとりした良好な使用感であった。また、0℃、25℃、50℃に保存したところ、いずれも安定で分離等は起こらなかった。なお、比較例として、イソステアрилポリグルコシドの代わりに非イオン界面活性剤であるPOE(1

5)オレイルエーテルを5.0wt%用いて同様に化粧水を調製したところ、油滴が分離し、油性成分に対して可溶化能が低かった。このことから、本発明の可溶化剤は従来の非イオン性界面活性剤よりも可溶化能が優れていることが示唆された。

【0028】

#### 配合例2 化粧水

水相部；

(1)ラクトース	1.0wt%
(2)カルボキシビニルポリマー	1.0
(3)イソステアрилポリグルコシド(平均重合度2.5)	6.0
(4)1,3-ブチレングリコール	4.0
(5)精製水	残 余

アルコール部；

(1)エタノール	2.0
(2)精製レシチン	0.2
(3)POE(60)硬化ヒマシ油	0.1
(4)香料	2.0
(5)メチルパラベン	0.3

【0029】油相部及びアルコール部をそれぞれ均一に溶解し、アルコール部を水相部に加えて可溶化し、化粧水を得た。この化粧水は透明な外観を呈し、しっとりした良好な使用感であった。また、0℃、25℃、50℃

に保存したところ、いずれも安定で分離等は起こらなかった。

【0030】

#### 配合例3 水性エッセンス

A部；

(1)1,3-ブチレングリコール	2.0wt%
(2)D-ガラクトサミン	1.0
(3)アルギニン	0.5
(4)コラーゲン	2.0
(5)カルボキシメチルポリマー	1.5
(6)イソステアрилポリグルコシド(平均重合度2.6)	5.0
(7)ジプロピレングリコール	適 宜

B部；

(1)エタノール	適 宜
(2)POE(60)硬化ヒマシ油	2.0
(3)ビタミンEアセテート	5.0
(4)香料	7.0
(5)オレイルアルコール	適 宜
(6)メチルパラベン	残 余

C部；

(1)水酸化カリウム	0.1
------------	-----

【0031】A部及びB部をそれぞれ均一に溶解し、A部にC部を加えて混合可溶化し、さらにC部を加えてエ

ッセンスを得た。このエッセンスは透明な外観を呈し、しっとりした良好な使用感であった。また、0℃、25

BEST AVAILABLE COPY

℃、50℃に保存したところ、いずれも安定で分離等は起こらなかった。

【0032】

【発明の効果】以上説明したように、本発明の可溶化剤は分岐脂肪族ポリグリコシドを含有し、且つ、前記分岐脂肪族ポリグリコシドの平均重合度が2.1以上であるという特徴を有し、これにより、優れた安全性、安定性

及び可溶化能が発揮され、皮膚に塗布した際には良好な使用感を有するという効果を有する。

【図面の簡単な説明】

【図1】本発明の一実施例であるイソステアрилポリグリコシド溶液の平均重合度による粘度変化を示す図である。

【図1】

